

# VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

Absender: DIE MIT DER INTERNATIONALEN VORLÄUFIGEN  
PRÜFUNG BEAUFTRAGTE BEHÖRDE

## PCT

An

BASF Aktiengesellschaft  
Patentabteilung ZDX/A-C6  
D-67056 LUDWIGSHAFEN  
ALLEMAGNE

Patentabteilung

17. JAN. 1997

MITTEILUNG ÜBER DIE ÜBERSENDUNG  
DES INTERNATIONALEN VORLÄUFIGEN  
PRÜFUNGSBERICHTS

(Regel 71.1 PCT)

Absendedatum  
(Tag/Monat/Jahr)

16. 01. 97

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts  
0050/45281

WICHTIGE MITTEILUNG

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 95/ 03963

Internationales Anmeldedatum  
(Tag/Monat/Jahr)

07/10/1995

Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr)

14/10/1994

Anmelder

BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al.

1. Dem Anmelder wird mitgeteilt, daß ihm die mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragte Behörde hiermit den zu der internationalen Anmeldung erstellten internationalen vorläufigen Prüfungsbericht, gegebenenfalls mit den dazugehörigen Anlagen, übermittelt.
2. Eine Kopie des Berichts wird - gegebenenfalls mit den dazugehörigen Anlagen - dem Internationalen Büro zur Weiterleitung an alle ausgewählten Ämter übermittelt.
3. Auf Wunsch eines ausgewählten Amtes wird das Internationale Büro eine Übersetzung des Berichts (jedoch nicht der Anlagen) ins Englische anfertigen und diesem Amt übermitteln.
4. **ERINNERUNG**  
Zum Eintritt in die nationale Phase hat der Anmelder vor jedem ausgewählten Amt innerhalb von 30 Monaten ab dem Prioritätsdatum (oder in manchen Ämtern noch später) bestimmte Handlungen (Einreichung von Übersetzungen und Entrichtung nationaler Gebühren) vorzunehmen (Artikel 39 (1)) (siehe auch die durch das Internationale Büro mit Formblatt PCT/IB/301 übermittelte Information).

Ist einem ausgewählten Amt eine Übersetzung der internationalen Anmeldung zu übermitteln, so muß diese Übersetzung auch Übersetzungen aller Anlagen zum internationalen vorläufigen Prüfungsbericht enthalten. Es ist Aufgabe des Anmelders, solche Übersetzungen anzufertigen und den betroffenen ausgewählten Ämtern direkt zuzuleiten.

Weitere Einzelheiten zu dem maßgebenden Fristen und Erfordernissen der ausgewählten Ämter sind Band II des PCT-Leitfadens für Anmelder zu entnehmen.

Name und Postanschrift der mit der internationalen vorläufigen  
Prüfung beauftragten Behörde



Europäisches Patentamt  
D-80298 München  
Tel. (+49-89) 2399-0, Tx: 523656 epmu d  
Fax: (+49-89) 2399-4465

Bevollmächtigter Bediensteter

Göeller

Tel.

**VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT  
AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS**

**PCT**

**INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT**

(Artikel 18 sowie Regeln 43 und 44 PCT)

08/809699

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts <b>0050/45281</b>	<b>WEITERES VORGEHEN</b> siehe Mitteilung über die Übermittlung des internationalen Recherchenberichts (Formblatt PCT/ISA/220) sowie, soweit zutreffend, nachstehender Punkt 5	
Internationales Aktenzeichen <b>PCT/EP 95/03963</b>	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) <b>07/10/95</b>	(Frühestes) Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) <b>14/10/94</b>
Anmelder  <b>BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al.</b>		

Dieser internationale Recherchenbericht wurde von der Internationalen Recherchenbehörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 18 übermittelt. Eine Kopie wird dem Internationalen Büro übermittelt.

Dieser internationale Recherchenbericht umfaßt insgesamt 3 Blätter.

☒ Darüber hinaus liegt ihm jeweils eine Kopie der in diesem Bericht genannten Unterlagen zum Stand der Technik bei.

1. ☐ Bestimmte Ansprüche haben sich als nicht recherchierbar erwiesen (siehe Feld I).
2. ☐ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung (siehe Feld II).
3. ☐ In der internationalen Anmeldung ist ein Protokoll einer Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz offenbart; die internationale Recherche wurde auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt,
  - ☐ das zusammen mit der internationalen Anmeldung eingereicht wurde.
  - ☐ das vom Anmelder getrennt von der internationalen Anmeldung vorgelegt wurde,
    - ☐ dem jedoch keine Erklärung beigelegt war, daß der Inhalt des Protokolls nicht über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung in der eingereichten Fassung hinausgeht.
  - ☐ das von der Internationalen Recherchenbehörde in die ordnungsgemäße Form übertragen wurde.
4. Hinsichtlich der Bezeichnung der Erfindung
  - ☒ wird der vom Anmelder eingereichte Wortlaut genehmigt.
  - ☐ wurde der Wortlaut von der Behörde wie folgt festgesetzt.
5. Hinsichtlich der Zusammenfassung
  - ☒ wird der vom Anmelder eingereichte Wortlaut genehmigt.
  - ☐ wurde der Wortlaut nach Regel 38.2b) in der Feld III angegebenen Fassung von dieser Behörde festgesetzt. Der Anmelder kann der Internationalen Recherchenbehörde innerhalb eines Monats nach dem Datum der Absendung dieses internationalen Recherchenberichts eine Stellungnahme vorlegen.
6. Folgende Abbildung der Zeichnungen ist mit der Zusammenfassung zu veröffentlichen:
  - Abb. Nr. ☐ wie vom Anmelder vorgeschlagen ☐ keine der Abb.
  - ☐ weil der Anmelder selbst keine Abbildung vorgeschlagen hat.
  - ☐ weil diese Abbildung die Erfindung besser kennzeichnet.

## A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 6 C07D239/60 C07D403/12 C07D251/30 C07D239/96 C07D491/04  
A61K31/505

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

## B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 6 C07D

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

## C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	EP,A,0 481 512 (UBE) 22. April 1992 siehe Seite 1 - Seite 19; Ansprüche; Tabelle 1 ---	1
A	EP,A,0 517 215 (UBE) 9. Dezember 1992 siehe Seite 1 - Seite 40; Ansprüche; Beispiele 206,269; Tabelle 1 ---	1
A	EP,A,0 347 811 (IHARA CHEMICAL IND.) 27. Dezember 1989 siehe Ansprüche; Tabelle 1 ---	1
P,A	DE,A,43 35 950 (BASF) 27. April 1995 siehe Ansprüche; Tabelle 1 ---	1
P,A	DE,A,43 13 413 (BASF) 27. Oktober 1994 siehe das ganze Dokument ---	1
-/--		

☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

\* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

- "A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
- "E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
- "L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)
- "O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
- "P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

"&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

5. Februar 1996

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

9. 02. 96

Name und Postanschrift der Internationale Recherchenbehörde  
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+ 31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+ 31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Francois, J

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
P,A	DE,A,43 13 412 (BASF) 27. Oktober 1994 siehe das ganze Dokument -----	1

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

Application No

PCT/EP 95/03963

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP-A-0481512	22-04-92	AU-B- 652961 AU-B- 8597791 JP-A- 5125058 US-A- 5178663	15-09-94 30-04-92 21-05-93 12-01-93
EP-A-0517215	09-12-92	JP-A- 4360887 CN-A- 1067651 US-A- 5387575 JP-A- 5148242 JP-A- 5148245 JP-A- 5208962	14-12-92 06-01-93 07-02-95 15-06-93 15-06-93 20-08-93
EP-A-0347811	27-12-89	DE-D- 68914197 DE-T- 68914197 JP-A- 2085262 US-A- 4968340 US-A- 5087289	05-05-94 10-11-94 26-03-90 06-11-90 11-02-92
DE-A-4335950	27-04-95	NONE	
DE-A-4313413	27-10-94	AU-B- 6678094 WO-A- 9425443 FI-A- 954993 NO-A- 954210	21-11-94 10-11-94 19-10-95 14-12-95
DE-A-4313412	27-10-94	AU-B- 6568194 CA-A- 2160912 WO-A- 9425442 FI-A- 954994 NO-A- 954211	21-11-94 10-11-94 10-11-94 19-10-95 20-12-95

## PATENT COOPERATION TREATY

PCT

## NOTIFICATION OF ELECTION

(PCT Rule 61.2)

From the INTERNATIONAL BUREAU

To:

United States Patent and Trademark  
Office  
(Box PCT)  
Washington D.C. 20231  
United States of America

in its capacity as elected Office

Date of mailing (day/month/year)

23 May 1996 (23.05.96)

International application No.

PCT/EP95/03963

Applicant's or agent's file reference

0050/45281

International filing date (day/month/year)

07 October 1995 (07.10.95)

Priority date (day/month/year)

14 October 1994 (14.10.94)

Applicant

RIECHERS, Hartmut et al

1. The designated Office is hereby notified of its election made:



in the demand filed with the International Preliminary Examining Authority on:

21 February 1996 (21.02.96)



in a notice effecting later election filed with the International Bureau on:

2. The election ☒ was

was not

made before the expiration of 19 months from the priority date or, where Rule 32 applies, within the time limit under Rule 32.2(b).

The International Bureau of WIPO  
34, chemin des Colombettes  
1211 Geneva 20, Switzerland

Facsimile No.: (41-22) 740.14.35

Authorized officer

Ingrid Hours

Telephone No.: (41-22) 730.91.11

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT  
AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

PCT

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

(Artikel 36 und Regel 70 PCT)



REC'D 20 JAN 1997

PCT

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts <b>0050/45281</b>	WEITERES VORGEHEN siehe Mitteilung über die Übersendung des internationalen vorläufigen Prüfungsberichts (Formblatt PCT/IPEA/416)	
Internationales Aktenzeichen <b>PCT/EP 95/03963</b>	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) <b>07/10/1995</b>	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) <b>14/10/1994</b>
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK <b>C07D239/60</b>		
Anmelder <b>BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al.</b>		

1. Der internationale vorläufige Prüfungsbericht wurde von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt.
2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt kur Blätter einschließlich dieses Deckblatts.
- ☐ Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; dabei handelt es sich um Blätter mit Beschreibungen, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit vor dieser Behörde vorgenommenen Berichtigungen (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsrichtlinien zum PCT)
- Diese Anlagen umfassen insgesamt \_\_\_\_\_ Blätter.

3. Dieser Bericht enthält Angaben und die entsprechenden Seiten zu folgenden Punkten:
- I ☒ Grundlage des Berichts
  - II ☐ Priorität
  - III ☐ Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
  - IV ☐ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung
  - V ☒ Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
  - VI ☐ Bestimmte angeführte Unterlagen
  - VII ☐ Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung
  - VIII ☐ Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Datum der Einreichung des Antrags <b>21/02/1996</b>	Datum der Fertigstellung dieses Berichts <b>16.01.97</b>
Name und Postanschrift der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde  Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. (+49-89) 2399-0, Tx: 523656 epmu d Fax: (+49-89) 2399-4465	Bevollmächtigter Bediensteter  <b>J.-B. Ousset</b> Tel.

---

I. Grundlage des Berichts

---

1. Dieser Bericht wurde erstellt auf der Grundlage (Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigefügt, weil sie keine Änderungen enthalten.)

☒ der internationalen Anmeldung in der ursprünglich eingereichten Fassung.

☐ der Beschreibung, Seite/n \_\_\_\_\_, in der ursprünglich eingereichten Fassung.  
Seite/n \_\_\_\_\_, eingereicht mit dem Antrag.  
Seite/n \_\_\_\_\_, eingereicht mit Schreiben vom \_\_\_\_\_.  
Seite/n \_\_\_\_\_, eingereicht mit Schreiben vom \_\_\_\_\_.

☐ der Ansprüche, Nr. \_\_\_\_\_, in der ursprünglich eingereichten Fassung.  
Nr. \_\_\_\_\_, in der nach Artikel 19 geänderten Fassung.  
Nr. \_\_\_\_\_, eingereicht mit dem Antrag.  
Nr. \_\_\_\_\_, eingereicht mit Schreiben vom \_\_\_\_\_.  
Nr. \_\_\_\_\_, eingereicht mit Schreiben vom \_\_\_\_\_.

☐ der Zeichnungen, Blatt/Abb. \_\_\_\_\_, in der ursprünglich eingereichten Fassung.  
Blatt/Abb. \_\_\_\_\_, eingereicht mit dem Antrag.  
Blatt/Abb. \_\_\_\_\_, eingereicht mit Schreiben vom \_\_\_\_\_.  
Blatt/Abb. \_\_\_\_\_, eingereicht mit Schreiben vom \_\_\_\_\_.

2. Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:

☐ Beschreibung: Seite \_\_\_\_\_.  
☐ Ansprüche: Nr. \_\_\_\_\_.  
☐ Zeichnungen: Blatt/Abb. \_\_\_\_\_.

3. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der Änderungen erstellt worden, da diese aus den angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2 c)).

4. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:
-



## INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

V. Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erläuterungen zur Stützung dieser Feststellung

## 1. FESTSTELLUNG

Neuheit	Ansprüche _____	JA
	Ansprüche 1 _____	NEIN
Erfinderische Tätigkeit	Ansprüche _____	JA
	Ansprüche 1 _____	NEIN
Gewerbliche Anwendbarkeit	Ansprüche 1 _____	JA
	Ansprüche _____	NEIN

## 2. UNTERLAGEN UND ERLÄUTERUNGEN

- 1). Folgende Dokumente stehen der Prüfungsabteilung als nächstliegender Stand der Technik für den Anmeldungsgegenstand gemäß den Patentanspruch 1 zur Verfügung:

(A) DE-A-4313413  
(B) DE-A-4313412

- 2). Die Überlappung zwischen dem Inhalt der vorliegenden Anmeldung und dem Inhalt der Dokumente (A) (siehe Anspruch 1) und (B) (siehe Anspruch 1) zerstört die Neuheit der vorliegenden Anmeldung.

Um zu zeigen, daß es ein neues technisches Element gibt, hat sich die Anmelderin auf die Beispiele bezogen (Eingabe vom 10.07.96).

Trotzdem bleibt eine Überlappung zwischen dem Inhalt der vorliegenden Anmeldung und dem Inhalt des zitierten Standes der Technik bestehen.

Da weder die genannte Überlappung entfernt wurde noch die Anwesenheit eines neuen technischen Elements gezeigt

wurde, bleibt die vorliegende Anmeldung nicht neu.

- 3). Die Anmelderin hat sich die Aufgabe gestellt, weitere Carbonsäurederivate herzustellen, die die Bindung von Endothelin an den Rezeptor inhibieren können (S.1, Z 30-33).

Die Lösung wird von den im Anspruch 1 beschriebenen Verbindungen dargestellt.

Das Problem wird tatsächlich für die in der Tabelle 2 erwähnten Verbindungen gelöst, da sie die beanspruchte Aktivität besitzen.

Obwohl die Aufgabe für die in der Tabelle 2 erwähnten Verbindungen tatsächlich gelöst wurde, kann eine erfinderische Tätigkeit für den Umfang des Anspruchs 1 nicht anerkannt werden, und zwar aus den folgenden Gründen:

Aufgrund des verfügbaren Standes der Technik scheint es, daß die beschriebene antagonistische Aktivität der Verbindungen nicht zu erwarten war. Deswegen könnte eine erfinderische Tätigkeit für die getesteten Beispiele und für die offensichtlichen Äquivalente dieser Beispiele anerkannt werden, falls der Anspruch 1 neu wäre.

Eine Verallgemeinerung der sich als erfinderisch erweisenden Verbindungen im Anspruch 1 scheint akzeptabel soweit dies in vernünftigen Umfang geschieht und damit nicht über den durch die Artikel 33.3 und Regel 6 PCT festgelegten Rahmen hinausgeht.

Angeichts der Breite vom Anspruch 1 und die oben erwähnte Beanstandung erscheint es allerdings fraglich, ob alle innerhalb dieses Anspruchs liegenden Verbindungen auch tatsächlich die gestellte Aufgabe lösen, d.h. daß sie die beschriebene Aktivität aufweisen.

Die erfinderische Tätigkeit wird nicht anerkannt.

**VERTRÄGE ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT  
AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS**

# PCT

## INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

(Artikel 36 und Regel 70 PCT)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts <b>0050/45281</b>	WEITERES VORGEHEN <b>WEITERES VORGEHEN</b>	siehe Mitteilung über die Übersendung des internationalen vorläufigen Prüfungsberichts (Formblatt PCT/IPEA/416)
Internationales Aktenzeichen <b>PCT/EP 95/ 03963</b>	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) <b>07/10/1995</b>	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) <b>14/10/1994</b>
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK  <b>C07D239/60</b>		
Anmelder  <b>BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al.</b>		

1. Der internationale vorläufige Prüfungsbericht wurde von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt.



2. Dieser **BERICHT** umfaßt insgesamt 100 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.

☐ Außerdem liegen dem Bericht **ANLAGEN** bei; dabei handelt es sich um Blätter mit Beschreibungen, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit vor dieser Behörde vorgenommenen Berichtigungen (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsrichtlinien zum PCT)

Diese Anlagen umfassen insgesamt \_\_\_\_\_ Blätter.

3. Dieser Bericht enthält Angaben und die entsprechenden Seiten zu folgenden Punkten:

- I ☒ Grundlage des Berichts
- II ☐ Priorität
- III ☐ Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
- IV ☐ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung
- V ☒ Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
- VI ☐ Bestimmte angeführte Unterlagen
- VII ☐ Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung
- VIII ☐ Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Datum der Einreichung des Antrags  <b>21/02/1996</b>	Datum der Fertigstellung dieses Berichts  <b>16. 01. 97</b>
Name und Postanschrift der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde   Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. (+ 49-89) 2399-0, Tx: 523656 epmu d Fax: (+ 49-89) 2399-4465	Bevollmächtigter Bediensteter   <b>J.-B. Ousset</b> Tel. _____

---

I. Grundlage des Berichts

---

1. Dieser Bericht wurde erstellt auf der Grundlage (Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt, weil sie keine Änderungen enthalten.)

☒ der internationalen Anmeldung in der ursprünglich eingereichten Fassung.

☐ der Beschreibung, Seite/n \_\_\_\_\_, in der ursprünglich eingereichten Fassung.  
Seite/n \_\_\_\_\_, eingereicht mit dem Antrag.  
Seite/n \_\_\_\_\_, eingereicht mit Schreiben vom \_\_\_\_\_.  
Seite/n \_\_\_\_\_, eingereicht mit Schreiben vom \_\_\_\_\_.

☐ der Ansprüche, Nr. \_\_\_\_\_, in der ursprünglich eingereichten Fassung.  
Nr. \_\_\_\_\_, in der nach Artikel 19 geänderten Fassung.  
Nr. \_\_\_\_\_, eingereicht mit dem Antrag.  
Nr. \_\_\_\_\_, eingereicht mit Schreiben vom \_\_\_\_\_.  
Nr. \_\_\_\_\_, eingereicht mit Schreiben vom \_\_\_\_\_.

☐ der Zeichnungen, Blatt/Abb. \_\_\_\_\_, in der ursprünglich eingereichten Fassung.  
Blatt/Abb. \_\_\_\_\_, eingereicht mit dem Antrag.  
Blatt/Abb. \_\_\_\_\_, eingereicht mit Schreiben vom \_\_\_\_\_.  
Blatt/Abb. \_\_\_\_\_, eingereicht mit Schreiben vom \_\_\_\_\_.

2. Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:

☐ Beschreibung: Seite \_\_\_\_\_.  
☐ Ansprüche: Nr. \_\_\_\_\_.  
☐ Zeichnungen: Blatt/Abb. \_\_\_\_\_.

3. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der Änderungen erstellt worden, da diese aus den angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2 c)).

4. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:

---

V. Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erläuterungen zur Stützung dieser Feststellung

---

1. FESTSTELLUNG

Neuheit	Ansprüche _____	JA
	Ansprüche 1 _____	NEIN
Erfinderische Tätigkeit	Ansprüche _____	JA
	Ansprüche 1 _____	NEIN
Gewerbliche Anwendbarkeit	Ansprüche 1 _____	JA
	Ansprüche _____	NEIN

---

2. UNTERLAGEN UND ERLÄUTERUNGEN

- 1). Folgende Dokumente stehen der Prüfungsabteilung als nächstliegender Stand der Technik für den Anmeldungsgegenstand gemäß den Patentanspruch 1 zur Verfügung:

(A) DE-A-4313413  
(B) DE-A-4313412

- 2). Die Überlappung zwischen dem Inhalt der vorliegenden Anmeldung und dem Inhalt der Dokumente (A) (siehe Anspruch 1) und (B) (siehe Anspruch 1) zerstört die Neuheit der vorliegenden Anmeldung.

Um zu zeigen, daß es ein neues technisches Element gibt, hat sich die Anmelderin auf die Beispiele bezogen (Eingabe vom 10.07.96).

Trotzdem bleibt eine Überlappung zwischen dem Inhalt der vorliegenden Anmeldung und dem Inhalt des zitierten Standes der Technik bestehen.

Da weder die genannte Überlappung entfernt wurde noch die Anwesenheit eines neuen technischen Elements gezeigt

---

wurde, bleibt die vorliegende Anmeldung nicht neu.

- 3). Die Anmelderin hat sich die Aufgabe gestellt, weitere Carbonsäurederivate herzustellen, die die Bindung von Endothelin an den Rezeptor inhibieren können (S.1, Z 30-33).

Die Lösung wird von den im Anspruch 1 beschriebenen Verbindungen dargestellt.

Das Problem wird tatsächlich für die in der Tabelle 2 erwähnten Verbindungen gelöst, da sie die beanspruchte Aktivität besitzen.

Obwohl die Aufgabe für die in der Tabelle 2 erwähnten Verbindungen tatsächlich gelöst wurde, kann eine erfinderische Tätigkeit für den Umfang des Anspruchs 1 nicht anerkannt werden, und zwar aus den folgenden Gründen:

Aufgrund des verfügbaren Standes der Technik scheint es, daß die beschriebene antagonistische Aktivität der Verbindungen nicht zu erwarten war. Deswegen könnte eine erfinderische Tätigkeit für die getesteten Beispiele und für die offensichtlichen Äquivalente dieser Beispiele anerkannt werden, falls der Anspruch 1 neu wäre.

Eine Verallgemeinerung der sich als erfinderisch erweisenden Verbindungen im Anspruch 1 scheint akzeptabel soweit dies in vernünftigen Umfang geschieht und damit nicht über den durch die Artikel 33.3 und Regel 6 PCT festgelegten Rahmen hinausgeht.

Angesichts der Breite vom Anspruch 1 und die oben erwähnte Beanstandung erscheint es allerdings fraglich, ob alle innerhalb dieses Anspruchs liegenden Verbindungen auch tatsächlich die gestellte Aufgabe lösen, d.h. daß sie die beschriebene Aktivität aufweisen.

Die erfinderische Tätigkeit wird nicht anerkannt.

**VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT  
AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS**

**PCT**

**INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT**

(Artikel 18 sowie Regeln 43 und 44 PCT)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts <b>0050/45281</b>	<b>WEITERES VORGEHEN</b> siehe Mitteilung über die Übermittlung des internationalen Recherchenberichts (Formblatt PCT/ISA/220) sowie, soweit zutreffend, nachstehender Punkt 5	
Internationales Aktenzeichen <b>PCT/EP 95/03963</b>	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) <b>07/10/95</b>	(Frühestes) Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) <b>14/10/94</b>
Anmelder  <b>BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al.</b>		

Dieser internationale Recherchenbericht wurde von der Internationalen Recherchenbehörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 18 übermittelt. Eine Kopie wird dem Internationalen Büro übermittelt.

Dieser internationale Recherchenbericht umfaßt insgesamt 3 Blätter.

☒ Darüber hinaus liegt ihm jeweils eine Kopie der in diesem Bericht genannten Unterlagen zum Stand der Technik bei.

1. ☐ Bestimmte Ansprüche haben sich als nicht recherchierbar erwiesen (siehe Feld I).
2. ☐ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung (siehe Feld II).
3. ☐ In der internationalen Anmeldung ist ein Protokoll einer Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz offenbart; die internationale Recherche wurde auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt,
  - ☐ das zusammen mit der internationalen Anmeldung eingereicht wurde.
  - ☐ das vom Anmelder getrennt von der internationalen Anmeldung vorgelegt wurde,
    - ☐ dem jedoch keine Erklärung beigelegt war, daß der Inhalt des Protokolls nicht über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung in der eingereichten Fassung hinausgeht.
  - ☐ das von der Internationalen Recherchenbehörde in die ordnungsgemäße Form übertragen wurde.
4. Hinsichtlich der Bezeichnung der Erfindung
  - ☒ wird der vom Anmelder eingereichte Wortlaut genehmigt.
  - ☐ wurde der Wortlaut von der Behörde wie folgt festgesetzt.
5. Hinsichtlich der Zusammenfassung
  - ☒ wird der vom Anmelder eingereichte Wortlaut genehmigt.
  - ☐ wurde der Wortlaut nach Regel 38.2b) in der Feld III angegebenen Fassung von dieser Behörde festgesetzt. Der Anmelder kann der Internationalen Recherchenbehörde innerhalb eines Monats nach dem Datum der Absendung dieses internationalen Recherchenberichts eine Stellungnahme vorlegen.
6. Folgende Abbildung der Zeichnungen ist mit der Zusammenfassung zu veröffentlichen:

Abb. Nr. \_\_\_\_\_
  - ☐ wie vom Anmelder vorgeschlagen
  - ☐ weil der Anmelder selbst keine Abbildung vorgeschlagen hat.
  - ☐ weil diese Abbildung die Erfindung besser kennzeichnet.

☐ keine der Abb.

## A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 6 C07D239/60 C07D403/12 C07D251/30 C07D239/96 C07D491/04  
A61K31/505

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

## B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 6 C07D

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

## C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	EP,A,0 481 512 (UBE) 22. April 1992 siehe Seite 1 - Seite 19; Ansprüche; Tabelle 1 ---	1
A	EP,A,0 517 215 (UBE) 9. Dezember 1992 siehe Seite 1 - Seite 40; Ansprüche; Beispiele 206,269; Tabelle 1 ---	1
A	EP,A,0 347 811 (IHARA CHEMICAL IND.) 27. Dezember 1989 siehe Ansprüche; Tabelle 1 ---	1
P,A	DE,A,43 35 950 (BASF) 27. April 1995 siehe Ansprüche; Tabelle 1 ---	1
P,A	DE,A,43 13 413 (BASF) 27. Oktober 1994 siehe das ganze Dokument ---	1
-/--		

☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

\* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung, die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung, die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

"&amp;" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

5. Februar 1996

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

- 9. 02. 96

Name und Postanschrift der Internationale Recherchenbehörde  
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+ 31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+ 31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Francois, J



C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
P,A	DE,A,43 13 412 (BASF) 27. Oktober 1994 siehe das ganze Dokument -----	1

# INTERNATIONALE RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 95/03963

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP-A-0481512	22-04-92	AU-B- 652961	15-09-94
		AU-B- 8597791	30-04-92
		JP-A- 5125058	21-05-93
		US-A- 5178663	12-01-93
EP-A-0517215	09-12-92	JP-A- 4360887	14-12-92
		CN-A- 1067651	06-01-93
		US-A- 5387575	07-02-95
		JP-A- 5148242	15-06-93
		JP-A- 5148245	15-06-93
		JP-A- 5208962	20-08-93
EP-A-0347811	27-12-89	DE-D- 68914197	05-05-94
		DE-T- 68914197	10-11-94
		JP-A- 2085262	26-03-90
		US-A- 4968340	06-11-90
		US-A- 5087289	11-02-92
DE-A-4335950	27-04-95	KEINE	
DE-A-4313413	27-10-94	AU-B- 6678094	21-11-94
		WO-A- 9425443	10-11-94
		FI-A- 954993	19-10-95
		NO-A- 954210	14-12-95
DE-A-4313412	27-10-94	AU-B- 6568194	21-11-94
		CA-A- 2160912	10-11-94
		WO-A- 9425442	10-11-94
		FI-A- 954994	19-10-95
		NO-A- 954211	20-12-95

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES  
 IPK 6 C07D239/60 C07D403/12 C07D251/30 C07D239/96 C07D491/04  
 A61K31/505

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

## B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 6 C07D

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

## C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	EP,A,0 481 512 (UBE) 22. April 1992 siehe Seite 1 - Seite 19; Ansprüche; Tabelle 1 ---	1
A	EP,A,0 517 215 (UBE) 9. Dezember 1992 siehe Seite 1 - Seite 40; Ansprüche; Beispiele 206,269; Tabelle 1 ---	1
A	EP,A,0 347 811 (IHARA CHEMICAL IND.) 27. Dezember 1989 siehe Ansprüche; Tabelle 1 ---	1
P,A	DE,A,43 35 950 (BASF) 27. April 1995 siehe Ansprüche; Tabelle 1 ---	1
P,A	DE,A,43 13 413 (BASF) 27. Oktober 1994 siehe das ganze Dokument ---	1
	--- -/--	

☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

\* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

- \*A\* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
- \*E\* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
- \*L\* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)
- \*O\* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
- \*P\* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

\*T\* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

\*X\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

\*Y\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

\*&\* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

5. Februar 1996

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

-9.02.96

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde  
 Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2  
 NL - 2280 HV Rijswijk  
 Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
 Fax (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Francois, J

## C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
P,A	DE,A,43 13 412 (BASF) 27. Oktober 1994 siehe das ganze Dokument -----	1

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP-A-0481512	22-04-92	AU-B- 652961 AU-B- 8597791 JP-A- 5125058 US-A- 5178663	15-09-94 30-04-92 21-05-93 12-01-93
EP-A-0517215	09-12-92	JP-A- 4360887 CN-A- 1067651 US-A- 5387575 JP-A- 5148242 JP-A- 5148245 JP-A- 5208962	14-12-92 06-01-93 07-02-95 15-06-93 15-06-93 20-08-93
EP-A-0347811	27-12-89	DE-D- 68914197 DE-T- 68914197 JP-A- 2085262 US-A- 4968340 US-A- 5087289	05-05-94 10-11-94 26-03-90 06-11-90 11-02-92
DE-A-4335950	27-04-95	KEINE	
DE-A-4313413	27-10-94	AU-B- 6678094 WO-A- 9425443 FI-A- 954993 NO-A- 954210	21-11-94 10-11-94 19-10-95 14-12-95
DE-A-4313412	27-10-94	AU-B- 6568194 CA-A- 2160912 WO-A- 9425442 FI-A- 954994 NO-A- 954211	21-11-94 10-11-94 10-11-94 19-10-95 20-12-95